

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成 23 年 1 月 20 日 (2011.1.20)

【公表番号】特表 2010-511616 (P2010-511616A)

【公表日】平成 22 年 4 月 15 日 (2010.4.15)

【年通号数】公開・登録公報 2010-015

【出願番号】特願 2009-539340 (P2009-539340)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 471/04 1 0 3 S

A 6 1 P 25/28

【手続補正書】

【提出日】平成 22 年 11 月 25 日 (2010.11.25)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

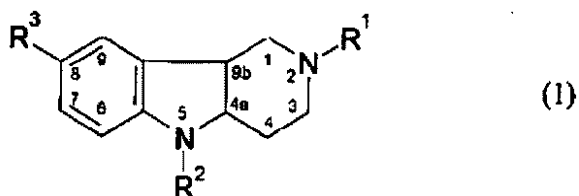
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1) の水素化ピリド (4, 3 - b) インドールまたはその薬学的に許容できる塩の、認知機能および記憶を改善するための手段としての使用

【化 4】



[式中、 R^1 は、 CH_3 -、 CH_3CH_2 - または $PhCH_2$ を含有する群から選択され；

R^2 は、 H -、 $PhCH_2$ - または $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2$ - を含有する群から選択され；

R^3 は、 H -、 CH_3 - または Br - を含有する群から選択される]。

【請求項 2】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が H - であり、 R^3 が CH_3 - である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

前記化合物が、(±)シス異性体の形態である、請求項 2 に記載の使用。

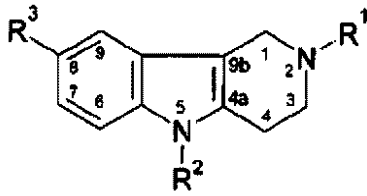
【請求項 4】

前記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩を含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 5】

式 (2) の水素化ピリド (4, 3 - b) インドールの、認知機能および記憶を改善するための手段としての使用

【化 5】



(2)

[式中、 R^1 は、 CH_3- 、 CH_3CH_2- または $PhCH_3$ を含有する群から選択され、

R^2 は、 $H-$ 、 $PhCH_2-$ または $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ を含有する群から選択され、

R^3 は、 $H-$ 、 CH_3- または $Br-$ を含有する群から選択される]。

【請求項 6】

R^1 が CH_3CH_2- または $PhCH_2-$ に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $H-$ である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 7】

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $PhCH_2-$ に対応し、 R^3 が CH_3- である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 8】

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ に対応し、 R^3 が $H-$ である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 9】

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ に対応し、 R^3 が CH_3- である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 10】

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $H-$ または CH_3- である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 11】

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $Br-$ である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 12】

前記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 13】

前記化合物が、2,8-ジメチル-5-[2-(6-メチル-ピリジル-3)-エチル]-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ピリド[4,3-b]インドール(ディメボン)である、請求項 5 に記載の使用。

【請求項 14】

活性成分および薬学的に許容できる担体を含有する、認知機能および記憶を改善させる特性を有する薬理的組成物であって、有効量の式(1)または式(2)の化合物を、活性成分として含有する組成物。

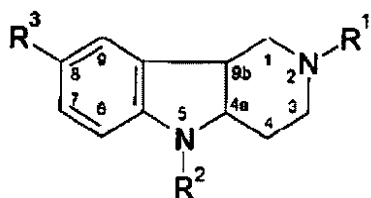
【請求項 15】

認知機能および記憶を改善するための組成物であって、有効量の式(1)の化合物または式(2)の化合物を含有し、該組成物は、1~150mgの該化合物の用量で、少なくとも1日に1回、治療効果を達成するために必要な期間にわたって投与されるものであることを特徴とする、組成物。

【請求項 16】

式(1)の水素化ピリド(4,3-b)インドールまたはその薬学的に許容できる塩を含む、認知機能および記憶を改善するための組成物

【化 4】



(1)

【式中、 R^1 は、 CH_3 -、 CH_3CH_2 - または $PhCH_2$ を含有する群から選択され；

R^2 は、 H -、 $PhCH_2$ - または $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2$ - を含有する群から選択され；

R^3 は、 H -、 CH_3 - または Br - を含有する群から選択される】。

【請求項 17】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が H - であり、 R^3 が CH_3 - である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記化合物が、(±)シス異性体の形態である、請求項 17 に記載の組成物。

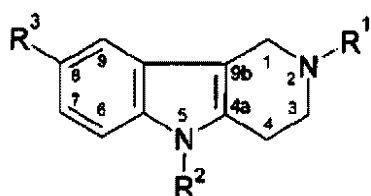
【請求項 19】

前記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩を含む、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 20】

式(2)の水素化ピリド(4,3-b)インドールを含む、認知機能および記憶を改善するための組成物

【化 5】



(2)

【式中、 R^1 は、 CH_3 -、 CH_3CH_2 - または $PhCH_3$ を含有する群から選択され；

R^2 は、 H -、 $PhCH_2$ - または $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2$ - を含有する群から選択され、

R^3 は、 H -、 CH_3 - または Br - を含有する群から選択される】。

【請求項 21】

R^1 が CH_3CH_2 - または $PhCH_2$ - に対応し、 R^2 が H - に対応し、 R^3 が H - である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が $PhCH_2$ - に対応し、 R^3 が CH_3 - である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 23】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2$ - に対応し、 R^3 が H - である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 24】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2$ - に対応し、 R^3 が CH_3 - である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 25】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が H - に対応し、 R^3 が H - または CH_3 - である、請

求項 20 に記載の組成物。

【請求項 26】

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が H - に対応し、 R^3 が Br - である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩である、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記化合物が、2, 8 - ジメチル - 5 - [2 - (6 - メチル - ピリジル - 3) - エチル] - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1H - ピリド [4, 3 - b] インドール (デイメボン) である、請求項 20 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0011】

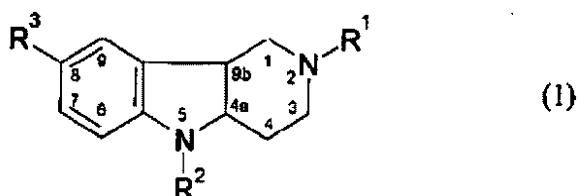
課題は、認知機能および記憶の新しい有効な刺激物質として活用することができる手段の蓄積を増すことであり、この課題に対する解決法を、今回、本発明が提案した。

本発明はまた、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (1) の水素化ピリド (4, 3 - b) インドールまたはその薬学的に許容できる塩の、認知機能および記憶を改善するための手段としての使用

【化 4】



[式中、 R^1 は、 CH_3 -、 CH_3CH_2 - または $PhCH_2$ を含有する群から選択され；

R^2 は、H -、 $PhCH_2$ - または 6 - CH_3 - 3 - Py - (CH_2)₂ - を含有する群から選択され；

R^3 は、H -、 CH_3 - または Br - を含有する群から選択される]。

(項目 2)

R^1 が CH_3 - に対応し、 R^2 が H - であり、 R^3 が CH_3 - である、項目 1 に記載の使用。

(項目 3)

上記化合物が、(±)シス異性体の形態である、項目 2 に記載の使用。

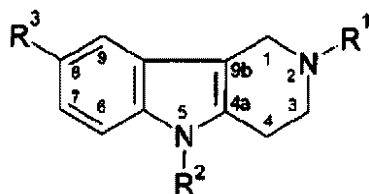
(項目 4)

上記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩を含む、項目 1 に記載の使用。

(項目 5)

式 (2) の水素化ピリド (4, 3 - b) インドールの、認知機能および記憶を改善するための手段としての使用

【化 5】



(2)

[式中、 R^1 は、 CH_3- 、 CH_3CH_2- または $PhCH_3$ を含有する群から選択され、

R^2 は、 $H-$ 、 $PhCH_2-$ または $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ を含有する群から選択され、

R^3 は、 $H-$ 、 CH_3- または $Br-$ を含有する群から選択される]。

(項目 6)

R^1 が CH_3CH_2- または $PhCH_2-$ に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $H-$ である、項目 5 に記載の使用。

(項目 7)

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $PhCH_2-$ に対応し、 R^3 が CH_3- である、項目 5 に記載の使用。

(項目 8)

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ に対応し、 R^3 が $H-$ である、項目 5 に記載の使用。

(項目 9)

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $6-CH_3-3-Py-(CH_2)_2-$ に対応し、 R^3 が CH_3- である、項目 5 に記載の使用。

(項目 10)

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $H-$ または CH_3- である、項目 5 に記載の使用。

(項目 11)

R^1 が CH_3- に対応し、 R^2 が $H-$ に対応し、 R^3 が $Br-$ である、項目 5 に記載の使用。

(項目 12)

上記化合物が、薬学的に許容できる酸との塩である、項目 5 に記載の使用。

(項目 13)

上記化合物が、2, 8 - ジメチル - 5 - [2 - (6 - メチル - ピリジル - 3) - エチル] - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロ - 1H - ピリド [4, 3 - b] インドール (デイメボン) である、項目 5 に記載の使用。

(項目 14)

活性成分および薬学的に許容できる担体を含有する、認知機能および記憶を改善させる特性を有する薬理学的組成物であって、有効量の式 (1) または式 (2) の化合物を、活性成分として含有する組成物。

(項目 15)

認知機能および記憶を改善するための方法であって、有効量の式 (1) の化合物または式 (2) の化合物を含有する薬理学的手段を、1 ~ 150 mg の用量で、少なくとも 1 日に 1 回、治療効果を達成するために必要な期間にわたって患者に投与するステップを含む方法。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0079

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 7 9 】

本発明による組成物は、錠剤の形態の場合には、1から20%の活性成分ならびに充填剤（複数の充填剤）および/または担体（複数の担体）を含有する。錠剤のために使用するものを以下に示す：a) 充填剤：甜菜糖、ラクトース、グルコース、塩化ナトリウム、ソルビトール、マンニトール、グリコール、二置換リン酸カルシウム；b) 結合剤：ケイ酸マグネシウムアルミニウム、デンプンペースト、ゼラチン、トラガカント、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロースおよびポリビニルピロリドン；c) 崩壊剤：デキストロース、寒天、アルギン酸またはその塩、デンプン、ツイーン。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0080

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 8 0 】

例 1

100mg 錠剤、各錠剤が、5mg のディメボン含有する

ディメボン 5mg

ラクトース 50.0mg

アルギン酸 20.0mg

クエン酸 5.0mg

トラガカント 20.0mg

錠剤は、活性成分を、1つまたは複数の補助的な成分と共に圧縮または成型することによって形成することができる。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0081

【補正方法】変更

【補正の内容】

【 0 0 8 1 】

圧縮錠剤を、特別な単位に調製する。粉末または顆粒等の遊離の形態の、50gの量（10000個の錠剤を調製するのに必要な物質の量）の活性成分を、結合剤としてのトラガカント（200g）と共に攪拌してから、充填剤としてのラクトース（550g）と共に混合し、崩壊剤としてのアルギン酸（200g）および着臭剤としてのクエン酸（50g）を、混合物中に添加する。